

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 1885

Ref. Expediente N° NC2019/0006687

Por la cual se deniega una Patente de Invención

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las conferidas en el numeral 24 del artículo 3° del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO:

Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 21 de junio de 2019, con el N° NC2019/0006687, por SYNGENTA PARTICIPATIONS AG, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “POLIMORFOS”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2017/082983 del 15 de diciembre de 2017.

Que la solicitud fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 864 el 28 de junio de 2019, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 11204, notificado el 19 de julio de 2022, se requirió al solicitante en los términos del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina para que presentara respuesta a las observaciones de carácter técnico, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión para la concesión de la patente.

Que el solicitante mediante escrito radicado bajo el N° NC2019/0006687 el 28 de noviembre de 2022, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó las reivindicaciones 1 a 3 que reemplazan las originalmente presentadas.

Se acepta este último capítulo reivindicatorio presentado, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486.

Que en virtud de lo dispuesto en el artículo 14 de la Decisión 486 expedida por la Comisión de la Comunidad Andina *“Los países miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial”*.

Que en el presente caso las reivindicaciones 1 a 3 incluidas en el radicado bajo el N° NC2019/0006687 el 28 de noviembre de 2022, no cumplen los requisitos indicados. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

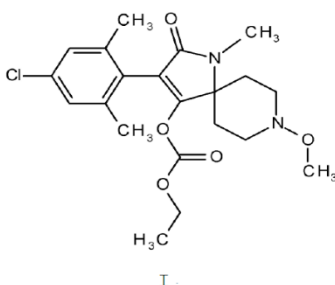
Objeto de la invención

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad proporcionar nuevas formas cristalinas para mejorar la estabilidad térmica de derivados espiroheterocíclicos de pirrolidina diona sustituidos con N-alquil amida que tienen actividad plaguicida, en particular, actividad insecticida.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona un polimorfo cristalino del compuesto de la Fórmula I.

Resolución N° 1885

Ref. Expediente N° NC2019/0006687

**Reivindicaciones** (Art. 30 Decisión 486)

En virtud de lo dispuesto en el artículo 30, de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina que señala: *“Las reivindicaciones definirán la materia que se desea proteger mediante la patente. Deben ser claras y concisas y estar enteramente sustentadas por la descripción. Las reivindicaciones podrán ser independientes o dependientes. Una reivindicación será independiente cuando defina la materia que se desea proteger sin referencia a otra reivindicación anterior. Una reivindicación será dependiente cuando defina la materia que se desea proteger refiriéndose a una reivindicación anterior. Una reivindicación que se refiera a dos o más reivindicaciones anteriores se considerará una reivindicación dependiente múltiple”*.

Las reivindicaciones presentan las siguientes observaciones:

- Las nuevas reivindicaciones 1 a 3 no cumplen con el requisito de claridad porque emplean la expresión: *“al menos”* (Reivindicación 1, 3); que es imprecisa, no define la materia adecuadamente y no limita el alcance de la reivindicación.

Descripción (Art. 28 Decisión 486 literal (e))

En virtud de lo dispuesto en el artículo 28, de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina que señala: *“La descripción deberá divulgar la invención de manera suficientemente clara y completa para su comprensión y para que una persona capacitada en la materia técnica correspondiente pueda ejecutarla. La descripción de la invención indicará el nombre de la invención e incluirá la siguiente información: e) una descripción de la mejor manera conocida por el solicitante para ejecutar o llevar a la práctica la invención, utilizando ejemplos y referencias a los dibujos, de ser éstos pertinentes.”*

El capítulo descriptivo no divulgó de manera suficientemente clara y completa la materia reivindicada para que la persona normalmente versada en la materia técnica correspondiente pueda ejecutarla o reproducirla, debido a que no menciona de forma específica cómo se obtuvo el *“polimorfo de la Forma A”*, el capítulo descriptivo indica que *“El compuesto de fórmula I se preparó de acuerdo con los métodos descritos en el documento WO 2010/066780. Este método conduce a la producción con forma de aguja fina del polimorfo de Forma A de Referencia”* (Pág. 51, Línea 5-8), no obstante, en dicha publicación no se menciona que se obtenga una forma cristalina del compuesto de fórmula I, ni que este tenga forma de aguja; por lo cual es desconocido como se obtuvo ese primer cristal.

Resolución N° 1885

Ref. Expediente N° NC2019/0006687

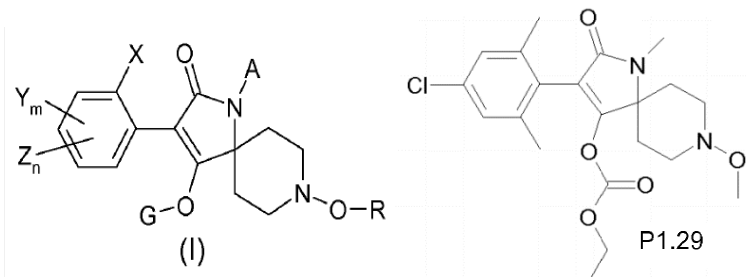
Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 22 de diciembre de 2016 que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de prioridad.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2010066780	"Spiroheterocyclic n-oxypiperidines as pesticides"	17 de junio de 2010
D4	Olenik, B. y Thielking, G.	"Polymorphism and the Organic Solid State: Influence on the Optimization of Agrochemicals"	15 de octubre de 2012

D1¹ divulga compuestos de fórmula (I), con actividad pesticida, entre los que se encuentra el compuesto P1.29 (Reivindicación 1, Pág. 141).



D4² enseña la importancia del polimorfismo en el diseño de productos agroquímicos y su influencia directa en propiedades que incluyen comportamientos de fusión, velocidades de disolución, liberación de sustancias y biodisponibilidad. El documento también se refiere a las técnicas utilizadas para caracterizar los diferentes polimorfos de agroquímicos y la patentabilidad de los polimorfos, con base en un ejemplo de un agroquímico (Pág. 249, Introducción, Pág. 270, Resumen).

Nivel Inventivo (Art. 18 Decisión 486)

Según lo dispuesto en el artículo 18 de la Decisión 486: *"Se considerará que una invención tiene nivel inventivo, si para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica"*.

En el presente caso, el producto reclamado en la solicitud no tiene nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 está referida a: *"Un polimorfo cristalino del compuesto de fórmula I caracterizado porque (...)"* (Radicado N° NC2019/0006687 el 28 de noviembre de 2022).

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y las reveladas en los documentos D1 y D4 que representan el estado de la técnica:

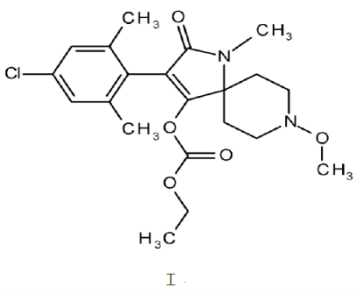
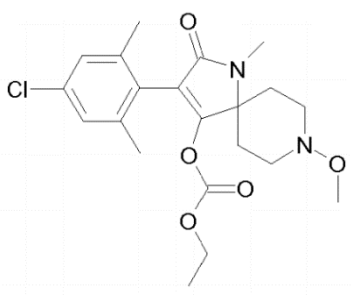
¹https://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2010066780A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20100617&D=B=&locale=en_EP

²Olenik, B. y Thielking, G. (2012). Polymorphism and the Organic Solid State: Influence on the Optimization of Agrochemicals. Capítulo 10, pp 249-272. <https://doi.org/10.1002/9783527655908.ch10>

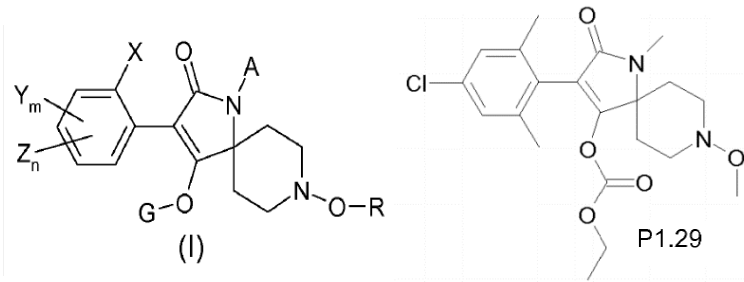
Resolución N° 1885

Ref. Expediente N° NC2019/0006687

Tabla 1. Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D4
Polimorfo cristalino del compuesto de fórmula I  I	Compuesto de fórmula I  (Pág. 141, P1.29)	Fundamentos teóricos del polimorfismo en agroquímicos y su caracterización analítica. (Pág. 249, Introducción)
patrón de difracción de rayos X de polvo que comprende un valor de ángulo 2θ a 9.4 ± 0.2, un valor de ángulo 2θ a 10.3 ± 0.2 y al menos tres valores del ángulo 2θ seleccionados del grupo constituido por 8.1 ± 0.2, 11.6 ± 0.2, 12.0 ± 0.2, 13.9 ± 0.2, 14.8 ± 0.2, 16.0 ± 0.2, 18.2 ± 0.2, 18.8 ± 0.2, 20.4 ± 0.2, 20.6 ± 0.2, 21.2 ± 0.2, 21.7 ± 0.2, 21.9 ± 0.2, 22.1 ± 0.2, 22.4 ± 0.2 y 23.4 ± 0.2;	-----	Técnicas utilizadas para caracterizar los diferentes polimorfos de agroquímicos; termogravimetría, calorimetría de barrido diferencial, espectroscopia IR y Raman y análisis por difracción de rayos X
Punto de fusión: 120 °C ± 2 °C.	Punto de Fusión: 130-132°C (Pág. 141, P1.29)	(Pág. 255- 268, Sección 10.3)

D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga derivados de pirrolidina diona espiroheterocíclica sustituida con N-alquilamida de formula (I), procesos para prepararlos, composiciones pesticidas, insecticidas, acaricidas, molusquicidas y nematocidas que los comprenden y métodos para combatir y controlar plagas tales como: insectos, ácaros, moluscos y nematodos (Pág. 1, Línea 1 -5). Entre los compuestos de fórmula (I) se incluye el compuesto 1.29 (Pág. 141). Los compuestos de fórmula (I), sus tautómeros, y sus sales, pueden obtenerse también en forma de hidratos o incluir otros disolventes, por ejemplo los que hayan sido utilizado para la cristalización de compuestos que están presentes en forma sólida (Pág. 28, Línea 28-31). El compuesto P1.29 mostro actividad contra *Myzus persicae* (Pág. 161, 168)



La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D1 consiste en que la solicitud menciona específicamente un polimorfo cristalino del compuesto de fórmula I, caracterizado por XRPD y por su punto de fusión.



Resolución N° 1885

Ref. Expediente N° NC2019/0006687

No obstante, no es posible establecer un efecto técnico asociado al polimorfo cristalino del compuesto de fórmula I, ya que las pruebas de estabilidad del polimorfo se realizan comparando contra la “*Forma A de Referencia*” (Pág. 51), y no contra el sólido amorfo.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar el compuesto conocido en D1 para proporcionar el compuesto en otras formas sólidas alternativas?

Sin embargo, el estado de la técnica D4 ya enseña que el estado sólido y especialmente el polimorfismo de los agroquímicos es de suma importancia. El conocimiento de la estabilidad termodinámica y fisicoquímica constituye una herramienta que respalda el diseño de productos agroquímicos. Teniendo en cuenta que la protección de cultivos moderna implica la creación de productos de alta tecnología, el diseño de agroquímicos modernos de estado sólido es esencial para maximizar la calidad del producto (Pág. 270, Sección 10.5). De acuerdo con D4 las diferencias en las redes cristalinas de ingredientes activos como los agroquímicos son responsables de las diversas propiedades físico-químicas que influyen en importantes características tales como solubilidad, estabilidad termodinámica y mecánica, puntos de fusión, higroscopicidad, densidad y hábitos cristalinos. En consecuencia, la elección de una forma cristalina óptima es necesaria para impartir una influencia temprana en el desarrollo de procesos y formulaciones, y para crear agroquímicos utilizables (Pág. 250, Sección 10.2.1). De acuerdo con D4 generalmente, el sistema desea escapar de la sobresaturación lo más rápido como sea posible, y por lo tanto acepta la formación de una estructura cristalina que no es necesariamente la ideal y la transformación en la forma termodinámicamente más estable puede ocurrir más tarde, lo que se conoce como maduración de Ostwald (Pág. 255, Sección 10.2.4). D4 también divulga una descripción de las técnicas utilizadas para caracterizar los diferentes polimorfos de agroquímicos entre las que se encuentran: Análisis Térmico Diferencial y Calorimetría Diferencial de Barrido (DSC), termogravimetría, espectroscopia IR y Raman, y difracción de rayos X entre otros (Pág. 255-268, Sección 10.3).

De acuerdo con lo anterior, el polimorfo cristalino del compuesto de fórmula I, aunque es nuevo, por no encontrarse divulgado su espectro XRPD, se deriva de manera evidente de la naturaleza del estado sólido del compuesto 1, por la propiedad que tiene para formar nuevos polimorfos; lo cual es de amplio conocimiento en el estado de la técnica.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, estaría motivada a aplicar los conocimientos que se tienen sobre polimorfismo revelados en D4 en el compuesto de D1, para así llegar al objeto de la reivindicación 1. Por lo cual se considera obvia.

Dado que la reivindicación dependiente 2 no presenta alguna característica adicional que conceda nivel inventivo al polimorfo cristalino del compuesto de fórmula I de la reivindicación 1, se considera que tampoco tienen nivel inventivo.

En el presente caso, la composición reclamada en la solicitud no tiene nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 3 está referida a: “*Una composición agrícola que comprende (...)*” (Radicado N° NC2019/0006687 el 28 de noviembre de 2022).

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 3, y las reveladas en los documentos D1 y D4 que representan el estado de la técnica:

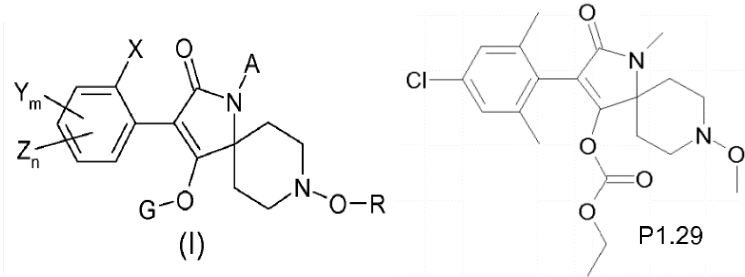
Resolución N° 1885

Ref. Expediente N° NC2019/0006687

Tabla 2. Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D4
Composición agrícola	Composición plaguicida (Reivindicación 4)	Importancia del polimorfismo en formulaciones de compuestos activos agroquímicos. (Pág. 255- 268, Sección 10.3)
Polimorfo según se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2	Compuesto de fórmula que incluye el compuesto P1. 29 (Espiropidion) (Reivindicación 4, Pág. 141)	
Al menos un portador o diluyente aceptable en agricultura	Adyuvantes de formulación (Reivindicación 4)	-----

D1 es considerado como el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 3, ya que divulga una composición plaguicida que comprende el compuesto de fórmula I, que incluye el compuesto P1.29 y adyuvantes de formulación (Reivindicación 4, Pág. 141).



La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 3 y la composición divulgada en D1 consiste en incluir el polimorfo cristalino del compuesto de fórmula (I).

No hay evidencia de que incluir el polimorfo cristalino del compuesto de fórmula (I) proporcione algún efecto técnico diferente al que ya proporciona la composición que comprende el compuesto de D1.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar la composición conocida en D1 para proporcionar composiciones alternativas?

Sin embargo, el estado de la técnica D4 enseña la optimización de las formulaciones agroquímicas, con la incorporación de polimorfos cristalinos y mediante el mejoramiento del control de proceso de cristalización de los ingredientes activos (Pág. 250, Sección 10.2.1, Pág. 251 Sección 10.2.3).

En consecuencia, la persona normalmente versada en la materia estaría motivada a incluir otras formas sólidas del compuesto 1.29 (Espiropidion) de D4, en la composición de D1, para así llegar al objeto de la reivindicación 3. Por lo cual se considera obvia.

Respuesta a los argumentos del solicitante

Argumentos respecto a la claridad

El solicitante afirma con relación a la caracterización del cristal que: *“Con base en lo establecido por ese Despacho en el Anexo de Polimorfos de la mencionada Guía, un polimorfo puede caracterizarse adecuadamente mediante cualquiera de los parámetros*



Resolución N° 1885

Ref. Expediente N° NC2019/0006687

fisicoquímicos listados. Asimismo, establece ese Despacho que el polimorfo deberá caracterizarse no solo por el PDRX sino también por al menos uno de los parámetros fisicoquímicos mencionados; este es el caso de la nueva Reivindicación 1, en la que se define el polimorfo no solo por el PDRX, sino también por el punto de fusión (obtenido mediante el método de análisis térmico DSC); esto es, por al menos uno de los parámetros que establece ese Despacho en la mencionada Guía. Por lo tanto, la nueva Reivindicación 1 caracteriza adecuadamente el polimorfo de la invención, y respetuosamente solicito tener por superada la observación.”

(.) Ese Despacho debe tener en cuenta que cualquier limitación en este sentido daría lugar a una limitación injustificada de la protección a realizaciones particulares de composiciones que comprenden el polimorfo de la invención. Por lo tanto, la expresión “al menos” no lleva a imprecisión ni falta de claridad, y respetuosamente solicito el retiro de las observaciones.”

Esta Oficina considera que la materia reclamada no cumplió con el requisito de claridad porque si bien se definió el polimorfo de Fórmula 1 con los picos de PDRX y el punto de fusión, no se retiró la expresión “al menos” (Reivindicación 1, 3) la cual es imprecisa, no define la materia y no limita el alcance de la reivindicación por lo que se ratifica que la materia reclamada no cumplió con el requisito de claridad.

El solicitante sostiene que: *“Así, cuando el Examinador afirma que D1 aporta información para que el técnico medio desee preparar formas cristalinas, reconoce que D1 sí habilita al técnico medio a cristalizar los compuestos divulgados en D1; por lo tanto, el mismo Examinador valida el hecho que la referencia de la presente Descripción al documento D1 sí aporta información técnica para que el versado en la materia ejecute la invención.”*

Se aclara que el citado argumento no es de recibo por parte de esta Oficina porque si bien como lo menciona el solicitante D1 proporciona información técnica para que el versado en la materia ejecute la invención, esto lo hace en conjunto con las enseñanzas del documento D4 tal como se indica en el análisis de nivel inventivo y adicionalmente que D1 aporte sugerencias para cristalizar los compuestos de Fórmula 1, no está relacionado con el hecho de que la descripción de la presente solicitud debió divulgar al menos un proceso para obtener el cristal semilla o primer polimorfo con el detalle suficiente de todas las etapas esenciales y las condiciones experimentales para que la persona normalmente versada en la materia pueda, poniéndolos en práctica, llegar al polimorfo reivindicado, por lo que persiste la objeción por falta de suficiencia del capítulo descriptivo.

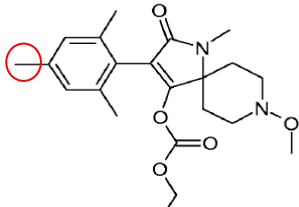
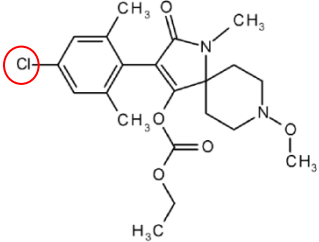
El solicitante sostiene que *“(…) lo que se requiere para formar el polimorfo de la invención es una solución del compuesto de fórmula (I), que como ejemplo se prepara a partir del polimorfo de referencia A, pero también podría prepararse a partir de otra forma en estado sólido que incluya una forma amorfa. (…) En vista de las anteriores consideraciones, es claro que la Descripción de la presente invención aporta “una descripción de la mejor manera conocida por el solicitante para ejecutar o llevar a la práctica la invención”, cumpliendo así con las disposiciones del literal e) del Artículo 28 de la Decisión 486. Por lo tanto, respetuosamente solicito el retiro de la observación a este respecto.”*

Esta Oficina reitera que persiste el requerimiento por falta de suficiencia del capítulo descriptivo, porque la divulgación de la invención no es lo suficientemente clara y completa para su comprensión y para que una persona capacitada en la materia técnica correspondiente pueda ejecutarla; porque dentro de la Descripción no existe la referencia a todas las etapas y condiciones del desarrollo del polimorfo cristalino que se reclama; la

Resolución N° 1885

Ref. Expediente N° NC2019/0006687

descripción debió ser redactada con suficiente detalle para que pueda ser reproducida. La descripción de la presente solicitud menciona que el “polimorfo de Forma A se obtuvo mediante el proceso divulgado en WO2010/066780 y que a partir de dicho proceso se obtiene un cristal en forma de agujas denominado A” (Pág. 51), sin embargo, en el documento citado no se encuentra el desarrollo de un proceso específico para sintetizar el compuesto P1.29, D1 en el ejemplo 1 solo describe una ruta sintética general para preparar compuestos de fórmula I en la tabla P1 y se refiere específicamente a la preparación del compuesto P1.2, que es estructuralmente diferente al P1.29, adicionalmente D1 menciona al finalizar la síntesis que: “La suspensión se agitó a 0°C durante una hora. La mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo y agua, las capas se separaron, la fase acuosa se extrajo con acetato de etilo, las fases orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/heptano 5:1), (Pág. 120, Ejemplo 1, Paso 2); claramente el documento no sugiere una etapa de cristalización del compuesto, sino la purificación por cromatografía, por lo que la persona del oficio versada en la materia no tendría los elementos suficientes para reproducir la invención y no es claro cuáles son los materiales de partida, los solventes, las etapas y las condiciones para preparar específicamente el polimorfo mencionado en la presente solicitud.

Compuesto P1.2 WO2010/066780	Compuesto de Fórmula I (Solicitud actual)
 (Pág. 120, Ejemplo1, Paso 2)	

Argumentos respecto a D1

El solicitante manifiesta que “Por lo tanto, no hay una enseñanza clara e inequívoca en D1 que motive a la preparación del polimorfo específico reivindicado en la presente solicitud; esto es, más allá del hecho que el compuesto preparado en D1 sea un cristal (Ver página 51 de la presente Descripción), D1 no enseña ni sugiere que el compuesto espiropidion pudiera cristalizar en más de una forma cristalina y mucho menos en una forma cristalina con propiedades de estabilidad superiores a la forma A de referencia, como reclama mí representada.”

Es oportuno aclarar que el Solicitante tiene razón al afirmar que D1 no sugiere específicamente una forma cristalina del espiropidion (Compuesto P1.29-D1, Pág. 141). No obstante si menciona que “Los compuestos de fórmula (I), sus tautómeros, y sus sales, pueden obtenerse también en forma de hidratos o incluir otros disolventes, por ejemplo los que hayan sido utilizado para la cristalización de compuestos que están presentes en forma sólida”(Pág. 28, Línea 28-31); y también indica que “Las mezclas de diastereómeros o las mezclas de racematos de los compuestos I, en forma libre o en forma de sal, que pueden obtenerse según los materiales de partida y los procedimientos elegidos, pueden separarse de manera conocida en los diastereómeros o racematos puros en la base de las diferencias fisicoquímicas de los componentes, por ejemplo por cristalización fraccionada, destilación o cromatografía.” (Pág. 27, Línea 33-35, Pág. 28,



Resolución N° 1885

Ref. Expediente N° NC2019/0006687

Línea 1,2); luego D1 si sugiere que los compuestos de Formula (I) pueden cristalizar. También es importante mencionar que D1 no anticipa en su totalidad el polimorfo cristalino del compuesto de formula (I) que se está reclamando, por lo tanto, el documento es empleado para evaluar el nivel inventivo y no la novedad de la presente solicitud.

Argumentos respecto a nivel inventivo

El solicitante sostiene que; *“Como se ha explicado en detalle durante el trámite de la presente solicitud, el compuesto 1.29 de D1, el cual presenta un punto de fusión de 130°C a 132°C, corresponde a la forma cristalina A de referencia que se describe en la presente invención; de hecho, la solicitud tal como se presentó deja claro que el material de D1 (compuesto P1.29 con un punto de fusión de 130 - 132 grados Celsius), es decir, el polimorfo A de referencia, es cristalino. De este modo, los resultados de los ensayos de estabilidad que presenta el solicitante en la presente invención constituyen una prueba irrefutable del efecto inesperado del polimorfo reclamado por el solicitante frente a la forma conocida a partir del arte previo más cercano, es decir del documento D1. Por lo tanto, el polimorfo de la presente invención sí muestra un efecto técnico que, además, es inesperado, como lo requiere ese Despacho en aparte antes citado.”*

“(…) el polimorfo de la invención permanece sustancialmente sin cambios durante estos experimentos (en contraste con el polimorfo A de referencia), toda vez que se afirma que es poco probable que el polimorfo muestre un crecimiento de cristales no deseado, lo que significa que no experimenta ninguna transformación significativa de estado sólido. Así entonces, resulta absolutamente claro que la forma A de referencia desaparece cuando se somete a las condiciones de temperatura, mientras que el polimorfo de la invención no presenta cambios; tal resultado demuestra con absoluta certeza que el polimorfo de la invención es sorprendentemente más estable que la forma A de referencia (...).”

Es oportuno aclarar que, contrario a lo afirmado por el solicitante, no hay evidencia del efecto técnico del polimorfo cristalino del compuesto de fórmula I, porque los resultados obtenidos en las pruebas de DSC no se comparan con la forma amorfa sino que solo determinan la estabilidad empleando el polimorfo A como referencia, por lo que no es posible establecer el salto cualitativo o la mejora obtenida. Asimismo es importante resaltar que aunque se evidenciara una mayor estabilidad con respecto al sólido amorfo; este efecto, no sería sorprendente, puesto que la obtención de formas cristalinas estables corresponde a un trabajo rutinario en la obtención de polimorfos, teniendo en cuenta que D3 enseña que la elección de una forma cristalina óptima es necesaria para impartir una influencia temprana en el desarrollo de procesos y formulaciones, y para crear agroquímicos utilizables. Las formas sólidas deben cumplir numerosos requisitos, como buena solubilidad y estabilidad (D3, Sección 10.2.1); por lo tanto, también sería obvio para la persona normalmente versada en la materia encontrar las formas polimórficas más estables y sus condiciones de estabilidad e interconvertibilidad para el desarrollo óptimo del compuesto.

El solicitante argumenta que: *“Habiendo aclarado que los resultados presentados en la Descripción sí muestran el efecto de la invención, y que el uso de ensayo y error no es un argumento válido para concluir con certeza que un polimorfo presenta una propiedad inesperada, ese Despacho debe reconocer que los resultados reportados por el solicitante en la Descripción de la presente invención sí demuestran que el polimorfo reclamado tiene un efecto inesperado sobre la forma cristalina del arte previo más cercano, efecto que no es obvio ni se deriva de manera evidente a partir del arte previo D1 y D3, y como tal dicho polimorfo es inventivo.”*

Resolución N° 1885

Ref. Expediente N° NC2019/0006687

Esta Oficina reitera que D1 y D3 son pertinentes para afectar la patentabilidad polimorfo cristalino del compuesto de fórmula I, teniendo en cuenta que D1 ya había dado a conocer el compuesto de fórmula I (Pág. 141, P1.29)) y su actividad pesticida contra *Myzus persicae* (Pág. 161, 168) y la posibilidad que tienen los compuestos de Fórmula (I) de cristalizar (Pág. 28, Línea 28-31) y D3 divulga que las diferencias en las redes cristalinas de ingredientes activos como los agroquímicos son responsables de las diversas propiedades fisicoquímicas que influyen en importantes características tales como solubilidad, estabilidad termodinámica y mecánica, puntos de fusión, higroscopicidad, densidad y hábitos cristalinos. En consecuencia, la elección de una forma cristalina óptima es necesaria para impartir una influencia temprana en el desarrollo de procesos y formulaciones, y para crear agroquímicos utilizables (Pág. 250, Sección 10.2.1). Por lo cual la persona del oficio versada en la materia estaría motivada a aplicar los conocimientos que se tienen sobre polimorfismo revelados en D3 en el compuesto de D1, para así llegar al objeto de la reivindicación 1 y la reivindicación 3. Por lo cual se consideran obvias.

El solicitante indica que “Así, de cara al presente caso, el análisis presentado en el Oficio técnico parte del conocimiento ofrecido por la invención bajo estudio en cuanto a la existencia de formas cristalinas adicionales. Ese Despacho debe reconocer que D1 no menciona en lo absoluto que el compuesto espiropidion pueda presentar más de una forma cristalina, por lo que arbitrariamente suponer que con base en D3 se habría anticipado con expectativa razonable de éxito que una segunda forma cristalina presentaría estabilidad térmica mejorada, NO surge del arte previo sino de la divulgación hecha por el solicitante; esto es, usando retrospectiva.”

Esta Oficina reitera que D1 si sugiere que los compuestos de fórmula 1 pueden cristalizar (Pág. 28, Línea 28-31, Pág. 141) y es del conocimiento general de la persona del oficio versada en la materia que aproximadamente el 80% de las sustancias orgánicas existe en más de una forma cristalina, lo que indica que el polimorfismo no es la excepción sino la regla (D3, Sección 10.2.1). También es importante resaltar que para una persona versada en la materia no sería sorprendente obtener formas polimórficas que presenten mayor estabilidad entre ellas, puesto que su obtención corresponde a un trabajo rutinario en la síntesis de estos compuestos y si bien es cierto que solamente algunos polimorfos presentan propiedades deseables (D3, Sección 10.2.1), en este caso los hallazgos en relación a características fisicoquímicas del polimorfo cristalino del compuesto de fórmula I, son el resultado de un trabajo rutinario, en el cual el objetivo del investigador consiste en determinar las propiedades fisicoquímicas del compuesto, y el efecto de sus formas en las propiedades fisicoquímicas del activo, para seleccionar aquella que eventualmente pueda representar una ventaja industrial. Por tal razón, es evidente para una persona normalmente versada en la materia que diferentes formas cristalinas presentan diferentes estabilidades; por lo cual el supuesto efecto señalado por el solicitante no es sorprendente, y la solicitud carece de nivel inventivo.

Que de acuerdo con la modificación presentada por el solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2019/0006687 el 3 de septiembre de 2020 y teniendo en cuenta el objeto de la solicitud, se modifica el título de la invención el cual quedará de la siguiente manera: “POLIMORFO DEL COMPUESTO ESPIROPIDION”.

En conclusión, teniendo en cuenta que los argumentos del solicitante no desvirtúan de manera alguna las objeciones a la patentabilidad ya sustentadas, el Superintendente de Industria y Comercio,

Resolución N° 1885

Ref. Expediente N° NC2019/0006687

RESUELVE

ARTÍCULO 1: Denegar la patente de invención a la creación titulada “POLIMORFO DEL COMPUESTO ESPIROPIDION”.

ARTÍCULO 2: Notificar el contenido de la presente resolución a SYNGENTA PARTICIPATIONS AG, advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición, ante el Superintendente de Industria y Comercio, el cual podrá ser interpuesto en el momento de la notificación o dentro de los diez (10) días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., el 30 de enero de 2023



Firmado digitalmente
por: JUAN CAMILO
DURAN TELLEZ
Fecha: 2023.01.30
09:23:18 COT
Razón: Validez jurídica.
Ubicación: Bogotá,
Colombia.